

(12)

Solicitud de Patente Independiente

|                          |                                 |                    |   |
|--------------------------|---------------------------------|--------------------|---|
| (21) No de Solitud:      | P050102718                      | (71) Solicitantes: | GRÜNENTHAL GMBH<br>ZIEGLERSTRASSE 6 D-52078 AACHEN<br>DE DE- 52                     |
| (22) Fecha de Solicitud: | 29.06.2005                      | (72) Inventor/es:  | BARTHOLOMÄUS, JOHANNES DE<br>KUGELMANN, HEINRICH DE<br>ARKENAU. MARIE, ELISABETH DE |
| (30) Prioridad/es:       | 10 2004 032 049.7 DE 01.07.2004 |                    |   |

(54) FORMAS FARMACEUTICAS ORALES, CON LIBERACION CONTROLADA DE OPIOIDES, PROTEGIDAS FRENTE AL ABUSO Y PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACION

(57) Resumen:

Una forma farmacéutica oral, protegida frente al abuso, con liberación controlada de opioides para una administración única diaria, caracterizada porque comprende al menos un opioide (A) con potencial de crear dependencia, al menos un polímero (C) sintético y/o natural, opcionalmente materiales de matriz de liberación sostenida, adyuvantes (B) fisiológicamente compatibles, opcionalmente una cera (D) y opcionalmente al menos un recubrimiento de liberación sostenida, de modo que el componente (C) o (D) presenta, cada uno, una resistencia a la rotura de al menos 500 N, preferiblemente de al menos 750 N. Reivindicación 2: Forma farmacéutica según la reivindicación 1, caracterizada porque el opioide es al menos un opioide seleccionado del grupo que comprende oxycodona, hidromorfona, morfina, oximorfona, tramadol, sus estereoisómeros, sus racematos, sus enantiómeros, sus diastereómeros en cualquier combinación, sus compuestos fisiológicamente compatibles, preferiblemente sales fisiológicamente compatibles, de manera especialmente preferida clorhidrato o sulfato o sacarinato y solvatos, y sus derivados, preferiblemente ésteres, éteres o amidas. Reivindicación 3: Forma farmacéutica según la reivindicación 1, caracterizada porque como opioide está presente al menos un opioide seleccionado del grupo que comprende (2R,3R)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metilpentan-3-ol, (1RS,3RS,6RS)-6-dimetilaminometil-1-(3-metoxi-fenil)-ciclohexano-1,3-diol, (1R,2R)-3-(2- dimetilaminometil-ciclohexil)-fenol, sus sales fisiológicamente compatibles, preferiblemente clorhidratos, sulfatos, sacarinatos, enantiómeros, estereoisómeros, diastereómeros y racematos fisiológicamente compatibles y sus derivados fisiológicamente compatibles, preferiblemente éteres, ésteres o amidas. Reivindicación 6: Forma farmacéutica según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizada porque el polímero (C) es al menos un polímero seleccionado del grupo que comprende poli(óxidos de alquileo), polietilenos, polipropilenos, poli(cloruros de vinilo), policarbonatos, poliestirenos, poli(met)acrilatos, sus copolímeros y mezclas de al menos dos representantes de las clases poliméricas o polímeros mencionados. Reivindicación 13: Forma farmacéutica según una de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizada porque como cera (D) está presente al menos una cera natural, semisintética y/o sintética con un punto de ablandamiento de al menos 60°C. Reivindicación 21: Forma farmacéutica según una de las reivindicaciones 1 a 20, caracterizada porque presenta como

adyuvante (B) al menos uno de los siguiente componentes (a)-(f) que impiden el abuso: a) al menos una sustancia que irrita la cavidad nasal y/o faríngea, b) al menos un agente que aumenta la viscosidad que, con ayuda de una cantidad mínima necesaria de un líquido acuoso, preferiblemente como un extracto acuoso obtenido a partir de la forma farmacéutica, forma un gel que preferiblemente al introducirlo en otra cantidad de un líquido acuoso puede seguir distinguiéndose visualmente, c) al menos un antagonista para el principio activo con potencial de crear dependencia, d) al menos un emético, e) al menos un colorante como agente de rechazo, f) al menos una sustancia amarga.